

РАЗРАБОТКА ПОДХОДОВ К СИНТЕЗУ НЕТОКСИЧНЫХ МОЛЕКУЛЯРНЫХ КОМПЛЕКСОВ НА БАЗЕ АМИНОСОДЕРЖАЩИХ КАЛИКС[4]РЕЗОРЦИНОВ И ГИДРАЗИДОВ ФОСФОРИЛУКСУСНЫХ КИСЛОТ

*Крутов И.А.⁽¹⁾, Сайфутдинова М.Н.⁽¹⁾, Шаталова Н.И.⁽¹⁾, Гаврилова
Е.Л.⁽¹⁾, Тарасова Р.И.⁽¹⁾, Пашина И.П.⁽²⁾, Семин И.И.⁽²⁾*

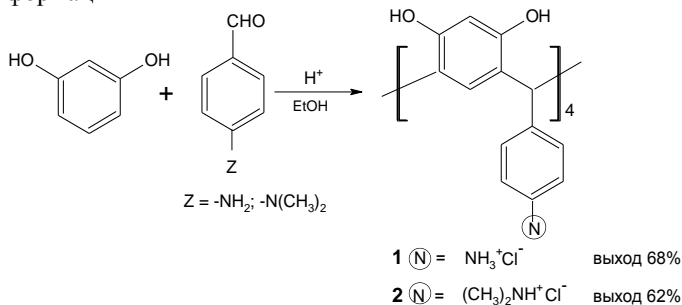
⁽¹⁾ Казанский государственный технологический университет
420015, г. Казань, ул. К. Маркса, д. 68

⁽²⁾ Казанский государственный медицинский университет
420012, г. Казань, ул. Бутлерова, д. 49

Каликс[4]резорцины – макроциклические тетрамеры, получающиеся реакцией конденсации резорцина с альдегидами. Одной из целей функционализации каликс[4]резорцинов является создание новых типов экстрагентов биологических молекул и лекарственных препаратов.

Нами были получены и исследованы на токсичность и фармакологическую активность аминосодержащие каликс[4]резорцины **1**, **2** в конформации

конус:

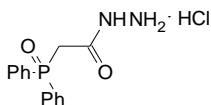


На стадии планирования фармакологических исследований соединений **1**, **2** проведен расчет прогнозируемой биологической активности с помощью программы PASS. Прогноз показал, что соединение **1** токсично, соединение **2** не токсично и проявляет биологическую активность в следующих областях: антисеборрейная, в качестве нейропротектора, противовирусного средства и т.д. Одновременно соединения **1**, **2** исследованы на токсичность в Казанском государственном медицинском университете. Результаты показали, что соединения **1** – токсично, а соединение **2** – не токсично, что совпадает с расчетными данными.

Фармакологическое исследование нетоксичного каликс[4]резорцина **2** подтвердило его ноотропное действие.

Каликс[4]резорцин **2** исследовали в реакции комплексообразования по типу «гость хозяин» с лекарственным препаратом ноотропного

действия — хлоргидратом Фосеназида **3** (2-(дифенилфосфорил)ацетогидразидом):



хлоргидрат Фосеназида 3

Молекулярный комплекс **4** исследован методами ЯМР¹H, ³¹P, ИК-спектроскопии, состав определялся методом элементного анализа. Данные элементного анализа указывают, что на одну молекулу хлоргидрата Фосеназида **3** приходится две молекулы каликс[4]резорцина **2**. Изучение фармакологической активности комплекса **4** показало, что введение молекулы хлоргидрата Фосеназида **3** в полость каликс[4]резорцина **2** позволяет существенно повысить ноотропное действие исходного лекарственного препарата.

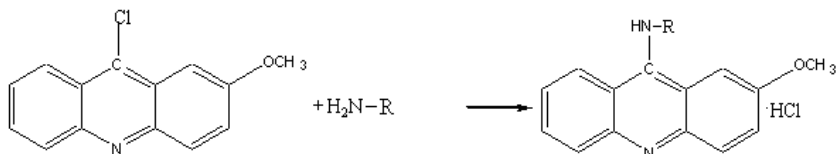
Работа выполнена при финансовой поддержке гранта МК-64832.2010.3.

СИНТЕЗ 9-АМИНОАКРИДИНОВ С ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИМ ЗАМЕСТИТЕЛЕМ В АМИНОГРУППЕ

Ламанов А., Маркович В.Ю., Кудрявцева Т.Н.

Юго-Западный государственный университет
305040, г. Курск, ул. 50 лет Октября, д. 94

С целью поиска новых индикаторов в ряду акридина, а также производных акридина, обладающих антибактериальной активностью [1,2], была осуществлена реакция 9-хлор-2-метоксиакридина с гетероциклическими аминами. Были проведены реакции по общей схеме:



Где R-NH₂: 2-аминопиридин, 2-аминотиазол, 4-амино-1,2,3-триазол.

Реакцию проводили в среде N,N-диметилформамида (ДМФА). Ход реакции контролировали методом ТСХ.

Показано, что выход соответствующего 9-замещенного аминоакридина максимален для 4-амино-1,2,3-триазола. В случае 2-аминопиридина выход продукта реакции не превышает 40 %, что, вероятно, связано с высокой растворимостью продукта реакции в ДМФА.